

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT


INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

REC'D 29 NOV 2005

WIPO

PCT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055025	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEAA416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2004/012119	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 27.10.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 29.10.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 8 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in computerlesbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p>		
<p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Bescheids</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags 15.03.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 29.11.2005	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl Fax: +31 70 340 - 3016	Bevollmächtigter Bediensteter Muellners, W Tel. +31 70 340-	



**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/012119

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
- ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
- ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt)*:

Beschreibung, Seiten

1-11 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-10 in der ursprünglich eingereichten Fassung

☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung: Seite
- ☐ Ansprüche: Nr.
- ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
- ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
- ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).

- ☐ Beschreibung: Seite
- ☐ Ansprüche: Nr.
- ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
- ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
- ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/012119

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

- | | |
|--------------------------------|---|
| 1. Feststellung | |
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 1-10
Nein: Ansprüche |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche
Nein: Ansprüche 1-10 |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-10
Nein: Ansprüche: |

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Zu Punkt V.

Es wird auf die folgenden im internationalen Recherchenbericht zitierten
Entgegenhaltungen (D1-D7) verwiesen:

- D1: EP-A-0 988 790
- D2: WO 98/46607 A
- D3: EP-A-0 236 272
- D4: US-A-5 593 996
- D5: US-B1-6 268 371
- D6: KOCH E ET AL: "Phenylpyrroles: A new class of fungicides for seed treatment"
BRIGHTON CROP PROTECTION CONFERENCE: PESTS AND DISEASES,
VOLS. 1, 2 AND 3 1992, Seiten 3) 1137-1146
- D7: DE 195 47 627 A1

Neuheit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 ist neu (Artikel 33(1) und (2) PCT).

Gegenstand des unabhängigen Anspruches 1 sind fungizide Mischungen zur Bekämpfung von Reispfadenen enthaltend Fenpiclonil einen Wirkstoff aus der Klasse der Phenylpyrrole und ein spezifisches fungizides Triazolopyrimidin (im folgenden TP1 genannt) in einer synergistisch wirksamen Menge. Die übrigen unabhängigen Ansprüche 4, 9 und 10 richten sich auf ein Verfahren zur Bekämpfung von reispfadenen Schadpilzen mittels einer solchen Mischung, auf aus einem solchen Verfahren resultierendes Saatgut, das eine solche Mischung enthält, bzw. auf die Verwendung der beiden Verbindungen zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von reispfadenen Schadpilzen.

Keine der genannten Entgegenhaltungen offenbart die spezifischen Mischungen, die Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind..

D1 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) synergistische Mischungen von Triazolopyrimidinen einer allgemeinen Formel, unter die auch TP1 fällt, mit anderen Fungiziden, unter ihnen auch Fenpiclonil. Die bevorzugten und in Beispielen benutzten Azolopyrimidine A, B und C (im folgenden TPa, TPb bzw. TPc

genannt) sind das 6-(2-Cl-6-F-Phenyl)-, das 7-(2,2,2-Trifluorethylamino)- bzw. das 7-(1,1,1-Trifluoropropyl-2-yl-amino)-Analoge des TP1. Im Beispiel (D1, Beispiel 25) wird TPc, die Vergleichssubstanz der vorliegenden Anmeldung, zusammen mit Fenpiclonil verwendet.

D2 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) u.a. spezifisch die Verbindung TP1 (Beispielverbindung 2). Die Verbindung wird hinsichtlich ihrer Wirkung gegen echten Mehltau auf Weintrauben mit TPa verglichen und überlegen gefunden. Die Möglichkeit der Mischung mit anderen Fungiziden, unter denen auch Fenpiclonil aufgeführt wird, unter Umständen unter Erzielung eines synergistischen Effektes, wird erwähnt aber nicht realisiert.

D3 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen), dass Fenpiclonil besonders geeignet zur Bekämpfung von *Botrytis* und zur Saatgutbehandlung ist.

D4 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) bestimmte fungizide Triazolopyrimidine, darunter TPa. Die Wirkung gegen *Pyricularia oryzae* auf Reis wird demonstriert (siehe D4, Beispiele 225 und 226).

D5 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) synergistische Mischungen von unter anderem aus D4 bekannten Triazolopyrimidinen mit Melaninbiosynthesehemmern wie Carpropamid, Pyroquilon und Fenoxanil. Diese Mischungen sind insbesondere wirksam gegen Reispfadogene (*Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani* und *Cochliobolus miyabeanus*, der die Braunfleckenkrankheit verursacht). Die bevorzugten in D5 als Azolopyrimidine A, C und D bezeichneten Verbindungen sind die oben erwähnten TPa, TPb bzw. TPc.

D6 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) Fenpiclonil und CGA173506, das heute unter dem Namen Fludioxonil bekannt ist, als Vertreter einer neuen Klasse von Fungiziden, den Phenylpyrrolen.

D schließlich offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) synergistische Mischungen des Fungizids Carpropamid mit unter anderen den Phenylpyrrolen Fenpiclonil und Fludioxinil.

Erfinderische Tätigkeit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 beruht nicht auf einer erfinderischen Tätigkeit (Artikel 33(1) und (3) PCT).

Im Lichte der Beschreibung und des nächsten Standes der Technik der Entgegenhaltung D1 kann als die der Anmeldung zugrundeliegende Aufgabe die Bereitstellung synergistischer Mischungen von Triazolopyrimidinen mit anderen Fungiziden angesehen werden, die sich zur Bekämpfung von Reispathogenen eignen, das heißt, die eine hohe Systemik mit einer guten Wirksamkeit gegen Pathogene wie *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani* und *Cochliobolus miyabeanus* vereinen.

Die vorgeschlagene Lösung ist durch die Verwendung des spezifischen Triazolopyrimidins TP1 in Kombination mit dem Fenpiclonil gekennzeichnet.

In Anbetracht des oben dargelegten Standes der Technik ist diese Kombination eine naheliegende Lösung der Aufgabe.

In D1 werden bereits Mischungen von Triazolopyrimidinen einer allgemeinen Formel, die sowohl TPa, TPb und TPc als auch TP1 umfasst, mit Fenpiclonil vorgeschlagen. Spezifisch offenbart wird dort die Mischung mit dem Triazolopyrimidin TPc. Die Entgegenhaltung erwähnt nicht ausdrücklich die Verwendung zur Bekämpfung von Reispathogenen.

Die Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel sind aber aus der Entgegenhaltung D4 als wirksam gegen Reispathogene bekannt, so wird dort z.B. die Wirksamkeit des TPa (Verbindung 139, in D4) gegen *Pyricularia oryzae* beispielhaft demonstriert (siehe Beispiel 226).

Aus D5 (siehe oben) sind synergistische Mischungen solcher Triazolopyrimidine darunter wiederum TPa und das in der vorliegenden Anmeldung als Vergleichssubstanz herangezogene TPc mit anderen Fungiziden bekannt. Diese Mischungen sind insbesondere gegen Reispathogene wie *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani* und *Cochliobolus miyabeanus* wirksam.

Andererseits ist auch bekannt, z.B. aus den Entgegenhaltungen D3, D6 und D, dass Fenpiclonil allein und in synergistischen Mischungen gute Wirksamkeit gegen solche Reispathogene zeigt.

So führt D3 hinsichtlich Fenpiclonil aus: "Die Wirkung gegen den Erreger *Rhizoctonia solani* (=sheath blight) in Reiskulturen ist besonders hervorzuheben." (siehe D3 Seite 2, die letzten 3 Zeilen des zweiten Absatzes). In einem Beispiel (biologisches Beispiel 2) wird die Wirkung gegen *Pyricularia oryzae* auf Reis demonstriert.

D6 lehrt das die Phenylpyrrole Fenpiclonil und Fludioxinil besonders gut zur Behandlung von Saatgut geeignet sind. Die hohe Wirksamkeit von Fludioxinil gegen *Pyricularia oryzae* und *Cochliobolus miyabeanus* auf Reis wird beispielhaft demonstriert (siehe D6, die Zusammenfassung und Seite 144, letzter Absatz).

D schließlich hebt die gute Wirkung von Mischungen des Fungizids Carpropamid mit Phenylpyrrol-Fungiziden, wie Fenpiclonil und Fludioxinil, gegen Pathogene der Gattungen *Pyricularia*, *Cochliobolus* und *Rhizoctonia* hervor. In einem Beispiel wird die Wirksamkeit der Mischung mit Fenpiclonil gegen *Pyricularia oryzae* auf Reis demonstriert.

Der Fachmann konnte deshalb erwarten, dass das aus D1 bekannte Gemisch aus TPc und Fenpiclonil, dessen Wirksamkeit dort beispielhaft (Beispiel 25) nur gegen *Alternaria solani* auf Tomaten gezeigt wird, auch sehr gut zur Bekämpfung von Reispathogene geeignet ist, also eine Lösung der oben definierten Aufgabe ist.

Nun wird aber außerdem in D2 ausdrücklich betont, dass die dort offenbarten 6-(2,4,6-Trifluoropenyl)-triazolopyrimidine (wie z.B. TP1) gegenüber den aus D4 bekannten Triazolopyrimidinen (wie z.B. TPa und TPc) erhöhte Systemik und fungitoxische Wirkung gegen Reispathogene haben (siehe D2, Seite 7, Zeilen 9-11). Die gute Wirksamkeit speziell des TP1 gegen *Pyricularia oryzae* (= *Pyricularia grisea* f. sp. *oryzae*, Teleomorph: *Magnaporthe* gr. f. sp. *oryzae*) und *Rhizoctonia solani* wird in Beispielen gezeigt (siehe D2, Tabelle II).

Es war daher naheliegend die Wirksamkeit der in D1 vorgeschlagenen Gemische aus Fenpiclonil und einem Triazolopyrimidine entsprechend der dort gegebenen Formel (I) speziell gegen Reispathogene dadurch zu optimieren, dass man statt des im Beispiel 25 für einen Test gegen *Alternaria solani* auf Tomaten verwendeten TPc das für diesen Zweck überlegene aus D2 bekannte TP1 wählt.

Die in abhängigen Ansprüchen angeführten zusätzlichen Merkmale, wie z.B. die Mengenverhältnisse und Aufwandmengen sind im Rahmen des Üblichen, und können

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER
BERICHT ZUR PATENTIERBARKEIT
(BEIBLATT)**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/012119

deshalb keinen erfinderischen Beitrag bestimmen.

Industrielle Anwendbarkeit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 wird als industriell anwendbar erachtet (Artikel 33(1) and (4) PCT).